

IAP20 Reckitt Benckiser 18 APR 2006

ISOPENTYLCARBOXANILIDE ZUR BEKÄMPFUNG VON UNTERWÜNSCHTEN MIKROORGANISMEN

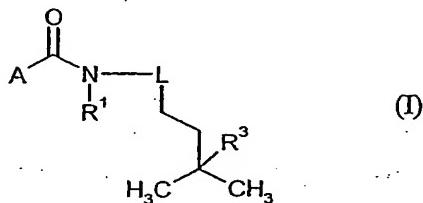
Die vorliegende Erfindung betrifft neue Isopentylcarboxanilide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

5

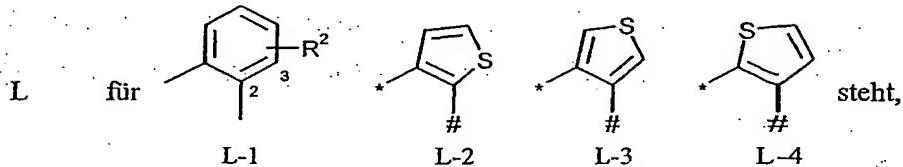
Es ist bereits bekannt, dass zahlreiche Carboxanilide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. WO 02/059086, WO 00/09482, EP-A 0 824 099, EP-A 0 755 927, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, JP 11-335364, JP 10-310577 und JP 10-251240). So sind beispielsweise 1-Methyl-N-[2-(3-methylbutyl)phenyl]-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid (aus EP-A 0 824 099) und 2,5-Dimethyl-N-[3-(3-methylbutyl)phenyl]-3-furamid (aus EP-A 0 755 927) bekannt. Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu wünschen übrig.

10

Es wurden nun neue Isopentylcarboxanilide der Formel (I)



15 gefunden, in welcher



wobei die mit * markierte Bindung mit dem Amid verbunden ist, während die mit # markierte Bindung mit der Alkylseitenkette verknüpft ist,

R¹ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils

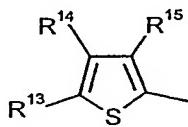
- 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^4$, $-CONR^5R^6$ oder $-CH_2NR^7R^8$ steht,
- R^2 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl steht,
- R^3 für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl steht,
- 5 R^4 für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, Halogen- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- 10 R^5 und R^6 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_8 -Halogenalkyl, Halogen- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- 15 R^5 und R^6 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^9 enthalten kann,
- R^7 und R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- 20 R^7 und R^8 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^9 enthalten kann,
- 25 R^9 für Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl steht,
- 25 A für den Rest der Formel (A1)
-
- (A1) steht, in welcher
- 30 R^{10} für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Cyano, Halogen, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy oder C_1 - C_4 -Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl- C_1 - C_4 -alkyl steht,
- R^{11} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, steht und

R¹² für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder für Phenyl steht,

5 mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Iod steht, wenn R¹¹ für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R³ und R¹¹ für Wasserstoff und R¹² für Methyl stehen,

oder

A für den Rest der Formel (A2)



(A2) steht, in welcher

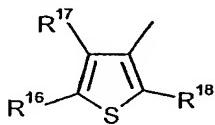
10

R¹³ und R¹⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R¹⁵ für Halogen, Cyano oder C₁-C₄-Alkyl, oder C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

15 oder

A für den Rest der Formel (A3)



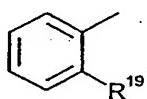
(A3) steht, in welcher

R¹⁶ und R¹⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

20 R¹⁸ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)



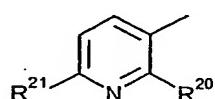
(A4) steht, in welcher

25

R¹⁹ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



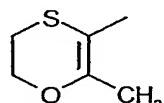
(A5) steht, in welcher

R²⁰ für Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht und

5 R²¹ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl steht,

oder

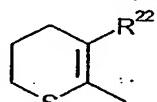
A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht,

10 oder

A für den Rest der Formel (A7)

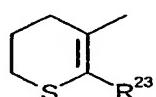


(A7) steht, in welcher

R²² für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

15 A für den Rest der Formel (A8)

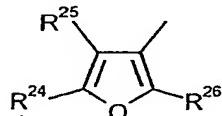


(A8) steht, in welcher

R²³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A9)



(A9) steht, in welcher

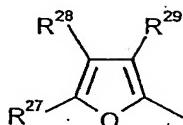
20

R²⁴ und R²⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

25 R²⁶ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 to 5 Halogenatomen steht, mit der Maßgabe, dass R²⁴ und R²⁶ nicht gleichzeitig für Methyl stehen, wenn R²⁵ für Wasserstoff steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



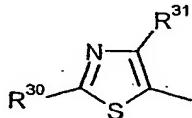
(A10) steht, in welcher

R²⁷ und R²⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R²⁹ für Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

5 oder

A für den Rest der Formel (A11)



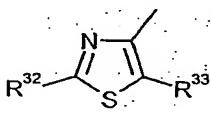
(A11) steht, in welcher

R³⁰ für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

10 R³¹ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht, mit der Maßgabe, dass R³¹ nicht für Trifluormethyl, Difluormethyl oder Methyl steht, wenn R³ für Wasserstoff und R³⁰ für Methyl stehen,

oder

15 A für den Rest der Formel (A12)



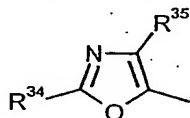
(A12) steht, in welcher

R³² für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R³³ für Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

20 oder

A für den Rest der Formel (A13)



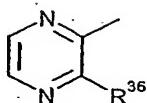
(A13) steht, in welcher

R³⁴ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht und

R³⁵ für Halogen oder C₁-C₄-Alkyl steht,

25 oder

A für den Rest der Formel (A14)

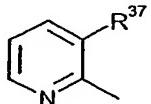


(A14) steht, in welcher

15 R³⁶ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

20 A für den Rest der Formel (A15)

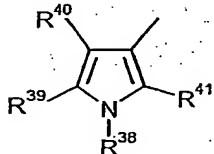


(A15) steht, in welcher

25 R³⁷ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylothio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

30 oder

A für den Rest der Formel (A16)



(A16) steht, in welcher

35 R³⁸ für Wasserstoff, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminosulfonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

40 R³⁹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

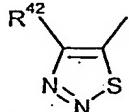
45 R⁴⁰ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

50 R⁴¹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R⁴⁰ nicht für Trifluormethyl steht,

oder

55 A für den Rest der Formel (A17)



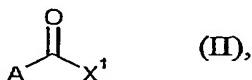
(A17) steht, in welcher

60 R⁴² für C₁-C₄-Alkyl steht.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z. B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Es werden sowohl die E- als auch die Z-Isomeren, wie auch die threo- und erythro-, sowie die optischen Isomeren, beliebige Mischungen dieser Isomeren, sowie die möglichen tautomeren Formen beansprucht.

Weiterhin wurde gefunden, dass man Isopentylcarboxanilide der Formel (I) erhält, indem man

a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

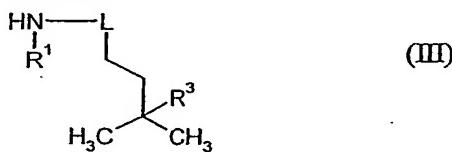


in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X¹ für Halogen oder Hydroxy steht,

mit einem Anilin-Derivat der Formel (III)

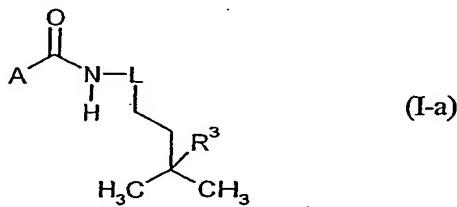


in welcher L, R¹ und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

b) Isopentylcarboxanilide der Formel (I-a)



in welcher L, A und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben

mit Halogeniden der Formel (IV)



in welcher

X² für Chlor, Brom oder Iod steht,

R^{1-A} für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl,

5

C_3 - C_8 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl; Halogen-(C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, Halogen-(C_1 - C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

10

(C_1 - C_8 -Alkyl)carbonyl, (C_1 - C_8 -Alkoxy)carbonyl, (C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl)carbonyl, (C_3 - C_8 -Cycloalkyl)carbonyl; (C_1 - C_6 -Halogenalkyl)carbonyl, (C_1 - C_6 -Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl)carbonyl, (C_3 - C_8 -Halogen-

cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder

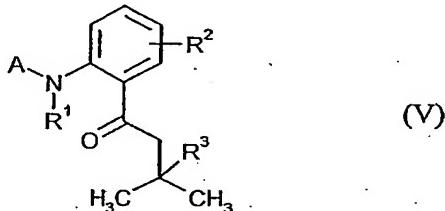
$-C(=O)C(=O)R^4$, $CONR^5R^6$ oder $-CH_2NR^7R^8$ steht,

wobei R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 die oben angegebenen Bedeutungen haben;

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

c) Isopenton-Derivate der Formel (V)

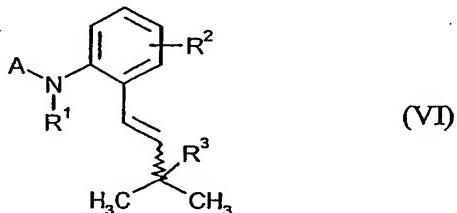


15

in welcher R^1 , R^2 , R^3 und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in
Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

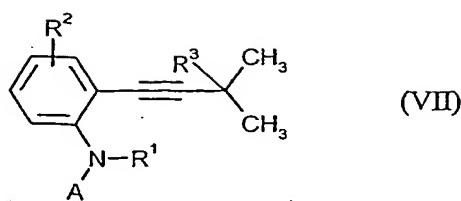
20 d) Isopenten-Derivate der Formel (VI)



in welcher R^1 , R^2 , R^3 und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart
eines Katalysators hydriert,

25 oder

e) Isopentin-Derivate der Formel (VII)



in welcher R¹, R², R³ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

5

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Isopentylcarboxanilide der Formel (I) sehr gute mikrobizide Eigenschaften besitzen und zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwendbar sind.

10 Die erfindungsgemäßen Isopentylcarboxanilide sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Restedefinitionen der vorstehenden und nachfolgend genannten Formeln sind im Folgenden angegeben. Diese Definitionen gelten für die Endprodukte der Formel (I) wie für alle Zwischenprodukte gleichermaßen.

15 L steht bevorzugt für L-1, wobei R² jeweils die allgemeinen, bevorzugten, besonders bevorzugten, ganz besonders bevorzugten oder insbesondere bevorzugten Bedeutungen haben kann.

L steht außerdem bevorzugt für L-2.

L steht außerdem bevorzugt für L-3.

20 L steht außerdem bevorzugt für L-4.

L steht besonders bevorzugt für L-1, wobei R² jeweils die allgemeinen, bevorzugten, besonders bevorzugten, ganz besonders bevorzugten oder insbesondere bevorzugten Bedeutungen haben kann.

L steht außerdem besonders bevorzugt für L-2.

25 L steht ganz besonders bevorzugt für L-1, wobei R² jeweils die allgemeinen, bevorzugten, besonders bevorzugten, ganz besonders bevorzugten oder insbesondere bevorzugten Bedeutungen haben kann.

R¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₈-Halogenycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-

alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 5 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸.

10 R¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchloromethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, 15 -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₂CH₃, -CH₂-CO₂CH(CH₃)₂, -CH₂-CO₂CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CH₃, -CH₂-CO-CF₃, -CH₂-CO-CCl₃, -CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂-CO-CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CF₃, 20 -(CH₂)₂-CO-CH₂CCl₃, -CH₂-CO₂CH₂CF₃, -(CH₂)₂-CO₂CF₂CF₃, -CH₂-CO₂CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO₂CCl₂CCl₃; Methylearbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹.

25 R¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Methoxymethyl, Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -C(=O)CHO, -C(=O)C(=O)CH₃, -C(=O)C(=O)CH₂OCH₃, -C(=O)CO₂CH₃, -C(=O)CO₂CH₂CH₃.

30 R² steht bevorzugt für Wasserstoff.

R² steht außerdem bevorzugt für Fluor, wobei Fluor besonders bevorzugt in 4-, 5- oder 6-Position, ganz besonders bevorzugt in 4- oder 6-Position, insbesondere in 4-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].

35 R² steht außerdem bevorzugt für Chlor, wobei Chlor besonders bevorzugt in 5-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)]. Chlor steht außerdem besonders bevorzugt in 4-Position des Anilidrestes.

R² steht außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].

R² steht außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 4- oder 5-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].

5

R³ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl mit 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R³ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-, iso-Propyl, n-, iso-, sec-, tert-Butyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder 10 Bromatomen.

R³ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl.

R⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-15 C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R⁴ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, tert-Butoxy, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluor-methoxy.

20

R⁵ und R⁶ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R⁵ und R⁶ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt 25 einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹ enthalten kann.

R⁵ und R⁶ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-30 oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.

R⁵ und R⁶ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, 35 Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin,

Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R⁹ substituiert sein kann.

R⁷ und R⁸ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl;

5 C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

10 R⁷ und R⁸ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹ enthalten kann.

15 R⁷ und R⁸ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluoreethyl, Trifluormethoxymethyl.

20 R⁷ und R⁸ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R⁹ substituiert sein kann.

25 R⁹ steht bevorzugt für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.

R⁹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl.

30 A steht bevorzugt für einen der oben angegebenen Reste
A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15 oder A16.

A steht besonders bevorzugt für einen der oben angegebenen Reste
A1, A2, A4, A5, A6, A9, A11, A12, A13, A14, A15 oder A16.

35 A steht ganz besonders bevorzugt für den Rest A1.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A2.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A4.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A5.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A6.

40 A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A9.

A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A11.

- A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A12.
- A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A13.
- A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A14.
- A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A16.

5

- R¹⁰ steht bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Cyclopropyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Aminocarbonyl, Aminocarbonylmethyl oder Aminocarbonylethyl mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Iod steht, wenn R¹¹ für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R³ und R¹¹ für Wasserstoff und R¹² für Methyl stehen.
- R¹⁰ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Dichlormethyl, Pentafluorethyl, Cyclopropyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethylthio oder Difluormethylthio, mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Iod steht, wenn R¹¹ für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R³ und R¹¹ für Wasserstoff und R¹² für Methyl stehen.
- R¹⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Cyclopropyl, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, -CHFCH₃ oder Difluormethoxy, mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Iod steht, wenn R¹¹ für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R³ und R¹¹ für Wasserstoff und R¹² für Methyl stehen.
- R¹⁰ steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Chlor, Methyl, Ethyl, Methoxy, Cyclopropyl, Monofluormethyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, -CHFCH₃ oder Difluormethoxy, mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R³ und R¹¹ für Wasserstoff und R¹² für Methyl stehen.
- R¹¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen,
- R¹¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder -CHFCH₃.

R¹¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Methyl oder -CHFCH₃.

R¹² steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder Phenyl.

R¹² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl oder Phenyl.

R¹² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl.

R¹² steht insbesondere bevorzugt für Methyl.

10

R¹³ und R¹⁴ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R¹³ und R¹⁴ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

15

R¹³ und R¹⁴ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.

R¹³ und R¹⁴ stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.

20

R¹⁵ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R¹⁵ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy.

R¹⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy.

25

R¹⁵ steht insbesondere bevorzugt für Chlor oder Methyl.

R¹⁶ und R¹⁷ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R¹⁶ und R¹⁷ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R¹⁶ und R¹⁷ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder Methyl.

R¹⁶ und R¹⁷ stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.

35

R¹⁸ steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R¹⁸ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl.

R¹⁸ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl.

R¹⁹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R¹⁹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Disfluorchlormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethoxy, Disfluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchlor-methylthio oder Trichlormethylthio.

R¹⁹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Difluor-methyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.

R¹⁹ steht insbesondere bevorzugt für Iod, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.

15

R²⁰ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Disfluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R²⁰ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Disfluorchlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluor-methylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethoxy, Disfluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy.

R²⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R²¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, C₁-C₂-Alkylsulfinyl oder C₁-C₂-Alkylsulfonyl.

30 R²¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethoxy, Difluor-methoxy, Disfluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Methylsulfinyl oder Methylsulfonyl.

R²¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Methylsulfinyl oder Methylsulfonyl.

R²¹ steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff.

R²² steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

5 R²² steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlor-methyl oder Trichlormethyl.

R²² steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlor-methyl.

10 R²³ steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R²³ steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluor-chlormethyl oder Trichlormethyl.

15 R²³ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlor-methyl.

R²⁴ und R²⁵ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

20 R²⁴ und R²⁵ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlor-methyl.

R²⁴ und R²⁵ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder Methyl.

R²⁴ und R²⁵ stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.

25 R²⁶ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogen-alkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R²⁶ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluor-methyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

30 R²⁶ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluor-methyl.

R²⁶ steht insbesondere bevorzugt für Methyl oder Trifluormethyl.

R²⁷ und R²⁸ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Nitro, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R²⁷ und R²⁸ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichloromethyl.

5 R²⁷ und R²⁸ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichloromethyl.

R²⁷ und R²⁸ stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.

R²⁹ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

10 R²⁹ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichloromethyl.

R²⁹ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichloromethyl.

R²⁹ steht insbesondere bevorzugt für Methyl.

15

R³⁰ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

20 R³⁰ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichloromethyl.

R³⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichloromethyl.

25 R³⁰ steht insbesondere bevorzugt für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.

R³¹ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Cyclopropyl, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

30 R³¹ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Cyclopropyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichloromethyl.

R³¹ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Methoxy, Cyclopropyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichloromethyl.

R³² steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

5 R³² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R³² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

10 R³² steht insbesondere bevorzugt für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.

R³³ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

15 R³³ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R³³ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R³³ steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl oder Difluormethyl.

20 R³⁴ steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.

R³⁴ steht besonders bevorzugt für Methyl.

R³⁵ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl.

R³⁵ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor oder Methyl.

25 R³⁶ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R³⁶ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl.

30 R³⁷ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

35 R³⁷ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl.

R³⁷ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

5 R³⁸ steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₂-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Methylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.

R³⁸ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Hydroxymethyl oder Hydroxyethyl.

10 R³⁸ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl oder Methoxymethyl.

R³⁹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R³⁹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

15 R³⁹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.

R⁴⁰ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R⁴⁰ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R⁴⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Methyl oder Trifluormethyl.

R⁴¹ steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

25 R⁴¹ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Trifluormethyl.

R⁴¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Trifluormethyl.

R⁴² steht bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl.

30 R⁴² steht besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-1 steht, wobei R² die oben angegebenen allgemeinen Bedeutungen hat.

35 Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-1 steht, wobei R² die oben angegebenen bevorzugten Bedeutungen hat.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-1 steht, wobei R² die oben angegebenen besonders bevorzugten Bedeutungen hat.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-1 steht, wobei R² die oben angegebenen ganz besonders bevorzugten Bedeutungen hat.

5 Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-1 steht, wobei R² die oben angegebenen insbesondere bevorzugten Bedeutungen hat.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-2 steht.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher R¹ für Wasserstoff steht.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher R¹ für Formyl steht.

10 Hervorgehoben sind außerdem Verbindungen der Formel (I), in welcher R¹ für -C(=O)C(=O)R⁴ steht, wobei R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen hat.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher A für A1 steht.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher R³ für Wasserstoff steht.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher R³ für Halogen, bevorzugt für Fluor,

15 Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Fluor, Chlor oder Brom, ganz besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor steht.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher R³ für C₁-C₈-Alkyl, bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-, iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, ganz besonders bevorzugt für Methyl oder Ethyl steht.

20 Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher R³ für C₁-C₈-Halogenalkyl, bevorzugt für C₁-C₆-Halogenalkyl mit 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, besonders bevorzugt für C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, ganz besonders bevorzugt für Trifluormethyl steht.

25 Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

30

Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

35

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen bzw. Erläuterungen können jedoch auch untereinander, also zwischen den jeweiligen Bereichen und

Vorzungsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

Die genannten Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem
5 können auch einzelne Definitionen entfallen.

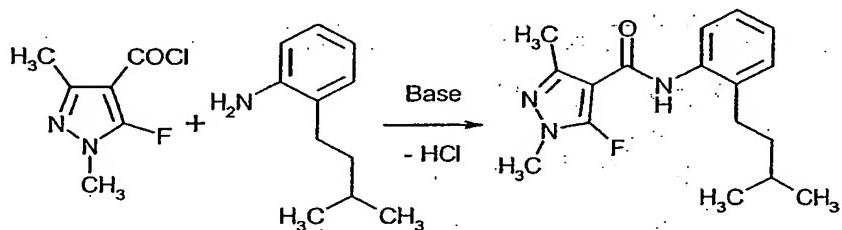
Bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), welche jeweils die unter bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt genannten Substituenten tragen.

10

Beschreibung der erfundungsgemäßen Verfahren zum Herstellen der Isopentylcarboxanilide der Formel (I) sowie der Zwischenprodukte

Verfahren (a)

15 Verwendet man 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonyl-chlorid und [2-(3-Methylbutyl)phenyl]-amin als Ausgangsstoffe, so kann das erfundungsgemäße Verfahren (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



Die zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten
20 Carbonsäure-Derivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) hat A
bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits
im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als
bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für A angegeben wurden. X¹ steht be-
vorzugt für Chlor, Brom oder Hydroxy.

25

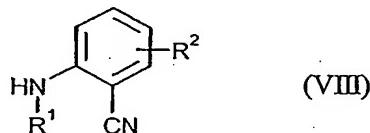
Die Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten
Verfahren herstellen (vgl. WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 und EP-A 0 589 313).

Die zur Durchführung des erfundungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe weiterhin benötig-
30 ten Anilin-Derivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben L, R¹
und R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die
bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel

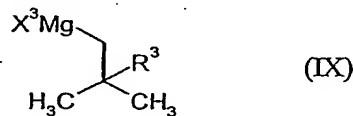
(I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.

Die Anilin-Derivate der Formel (III), in denen L für L-1 steht, sind teilweise neu. Anilin-Derivate der 5 Formel (III), in denen L für L-1 steht, lassen sich herstellen, indem man,

f) Cyanoaniline der Formel (VIII)

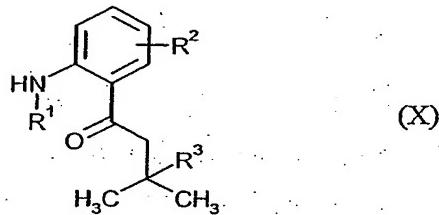


in welcher R¹ und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben,
in einem ersten Schritt mit einem Grignard-Reagenz der Formel (IX)



10

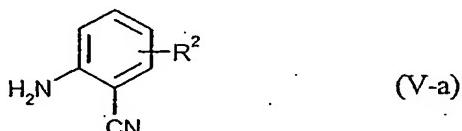
in welcher
R³ die oben angegebenen Bedeutungen hat,
X³ für Chlor, Brom oder Iod steht,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt und die so erhaltenen
15 Alkanonaniline der Formel (X)



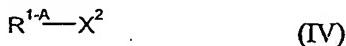
in welcher R¹, R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,
in einem zweiten Schritt mit Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) in Gegenwart einer Base (z.B.
Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide wie Natriumhydroxid oder Kaliumhydroxid) und ge-
gebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.
20

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten Cyanoaniline sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel (VIII) haben R¹ und R² bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits 25 im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Cyanoaniline der Formel (VIII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen. Cyanoaniline der Formel (VIII), in welcher R¹ nicht für Wasserstoff steht, können erhalten werden, indem man Cyanoaniline der Formel (V-a)



- 5 in welcher R² die oben angegebenen Bedeutungen hat,
mit Halogeniden der Formel (IV)



- in welcher R^{1-A} die oben angegebenen Bedeutungen hat,
in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt. [Die Reaktions-
10 bedingungen des Verfahrens (b) gelten entsprechend.]

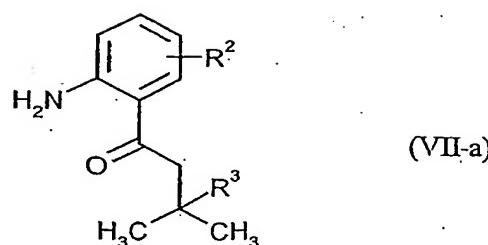
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Grignard-Reagenzien sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In dieser Formel (IX) hat R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits 15 im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden. X³ steht bevorzugt für Brom.

Die Grignard-Reagenzien der Formel (IX) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren 20 erhalten werden.

Die Alkanonaniline der Formel (X), die im erfindungsgemäßen Verfahren (f) als Zwischenprodukte durchlaufen werden sind neu und ebenfalls Gegenstand dieser Anmeldung. In der Formel (X) haben 25 die Reste R¹, R² und R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.

Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat), welches ebenfalls als Reagenz im erfindungsgemäßen Verfahren 30 (f) benötigt wird, ist eine bekannte Synthesekemikalie.

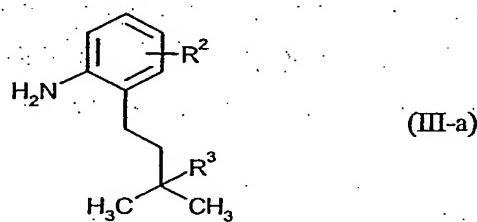
Das erfindungsgemäße Verfahren (f) kann in verschiedenen Varianten durchgeführt werden. So ist es möglich, zunächst Cyanoaniline der Formel (V-a) zu den entsprechenden Alkanonanilinen der Formel (VII-a)



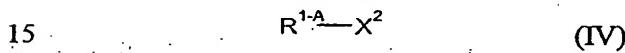
in welcher R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,
umzusetzen, welche dann gegebenenfalls mit Halogeniden der Formel (IV)



- 5 in welcher R^{1-A} die oben angegebenen Bedeutungen hat,
in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels zu den entsprechenden
Alkanonaniline der Formel (X) umgesetzt werden. [Die Reaktionsbedingungen des Verfahrens (b)
gelten entsprechend.]
- 10 Es ist jedoch auch möglich, die Alkanonaniline der Formel (VII-a) gemäß dem erfindungsgemäßen
Verfahren (f) zu den entsprechenden Anilin-Derivaten der Formel (III-a)



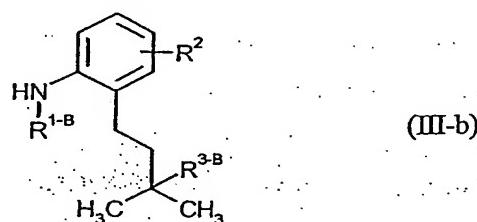
in welcher R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,
umzusetzen, welche dann gegebenenfalls mit Halogeniden der Formel (IV)



- in welcher R^{1-A} die oben angegebenen Bedeutungen hat,
in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels zu den entsprechenden Anilin-
Derivaten der Formel (III) umgesetzt werden. [Die Reaktionsbedingungen des Verfahrens (b) gelten
entsprechend.]

20

Anilin-Derivate der Formel (III-b)



in welcher

- a) R^{1-B} für C_1-C_8 -Alkyl, C_1-C_6 -Alkylsulfinyl, C_1-C_6 -Alkylsulfonyl, C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl; C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Halogenalkylthio, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_8 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- 5 R^{3-B} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_8 -Alkyl, C_1-C_8 -Halogenalkyl steht,
- oder
- 10 b) R^{1-B} für Wasserstoff, C_1-C_8 -Alkyl, C_1-C_6 -Alkylsulfinyl, C_1-C_6 -Alkylsulfonyl, C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl; C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Halogenalkylthio, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_8 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- C_1-C_3 -alkyl, (C_1-C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl, (C_1-C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl; Halogen-(C_1-C_3 -alkyl)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl, Halogen-(C_1-C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C_1-C_8 -Alkyl)carbonyl, (C_1-C_8 -Alkoxy)carbonyl, (C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl)carbonyl, (C_3-C_8 -Cycloalkyl)carbonyl; (C_1-C_6 -Halogenalkyl)carbonyl, (C_1-C_6 -Halogenalkoxy)carbonyl, (C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^4$, $CONR^5R^6$ oder $-CH_2NR^7R^8$ steht, und
- 15 R^{3-B} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_8 -Alkyl, C_1-C_8 -Halogenalkyl steht,
- oder
- 20 b) R^{1-B} für Wasserstoff, C_1-C_8 -Alkyl, C_1-C_6 -Alkylsulfinyl, C_1-C_6 -Alkylsulfonyl, C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl; C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Halogenalkylthio, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_8 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- C_1-C_3 -alkyl, (C_1-C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl, (C_1-C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl; Halogen-(C_1-C_3 -alkyl)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl, Halogen-(C_1-C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- 25 R^{3-B} für Halogen, C_1-C_8 -Alkyl, C_1-C_8 -Halogenalkyl steht,
- und
- 30 R^2, R^4, R^5, R^6, R^7 und R^8 jeweils die oben angegebenen Bedeutungen haben,
sind neu und ebenfalls Gegenstand dieser Anmeldung.

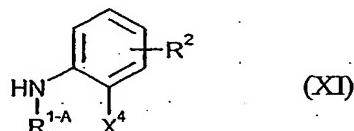
Die bevorzugten, besonders bevorzugten bzw. ganz besonders bevorzugten Bedeutungen von R^1 und R^3 finden auf R^{1-B} und R^{3-B} entsprechend Anwendung, wobei im Fall a) R^{1-B} jeweils nicht für Wasserstoff steht und im Fall b) R^{3-B} nicht für Wasserstoff steht. Die bevorzugten, besonders bevorzugten

bzw. ganz besonders bevorzugten Bedeutungen von R², R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ gelten ebenfalls für die neuen Verbindungen der Formel (III-b).

5 Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (III-b), in welcher R¹ und R² jeweils für Wasserstoff und R³ für Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl oder Pentafluorethyl steht.

Anilin-Derivate der Formel (III), in denen L für L-1 steht, werden außerdem erhalten, indem man

g) Anilinhalogenide der Formel (XI)

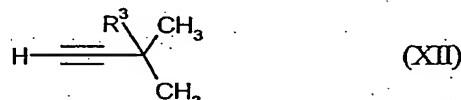


10 in welcher

R^{1-A} und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben und

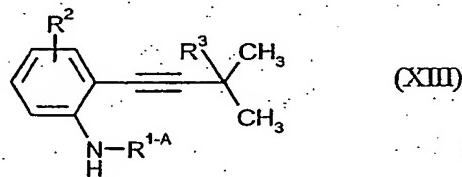
X⁴ für Halogen steht,

in einem ersten Schritt mit Alkinen der Formel (XII)



15 in welcher R³ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt und in einem zweiten Schritt die so erhaltenen Alkinaniline der Formel (XIII)



20 in welcher R^{1-A}, R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe benötigten 25 Anilinhalogenide sind durch die Formel (XI) allgemein definiert. In dieser Formel (XI) hat R² bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden. R^{1-A} hat bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die im Zu-

sammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (IV) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben sind.

- Die Anilinhalogenide der Formel (XI) sind bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren, z.B.
5 aus den entsprechenden am Stickstoff unsubstituierten Derivaten durch Umsetzung mit den Halogeniden der Formel (IV), erhalten werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Alkine sind durch die Formel (XII) allgemein definiert. In dieser Formel (XII) hat R³ bevorzugt,
10 besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden.

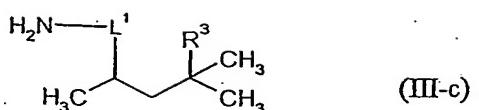
Die Alkine der Formel (XII) sind bekannt.

- 15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Zwischenprodukte durchlaufenden Alkinaniline sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel (XIII) haben R² und R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel
20 (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. R^{1-A} hat bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (IV) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben sind.
- 25 Die Alkinaniline der Formel (XIII) sind teilweise bekannt. Sie werden nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (g) erhalten.

Sollen Anilin-Derivate der Formel (III), in welcher R¹ für Wasserstoff steht, erhalten werden, so wird R^{1-A} entsprechend ausgewählt, um die Funktion einer Schutzgruppe zu erfüllen, welche im Anschluss
30 an das erfindungsgemäße Verfahren (g) nach üblichen Methoden wieder entfernt werden kann.

Die Anilin-Derivate der Formel (III), in denen L für L-2, L-3 oder L-4 steht, sind bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden (vgl. z.B. EP-A 1 036 793 und EP-A 0 737 682).

- 35 Anilin-Derivate der Formel (III), in denen L für L-2, L-3 oder L-4 steht und R¹ nicht für Wasserstoff steht, können erhalten werden, indem man Aniline der Formel (III-c)

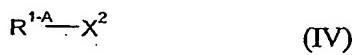


in welcher

L^1 für L-2, L-3 oder L-4 steht und

L-2, L-3, L-4 und R^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 mit Halogeniden der Formel (IV)



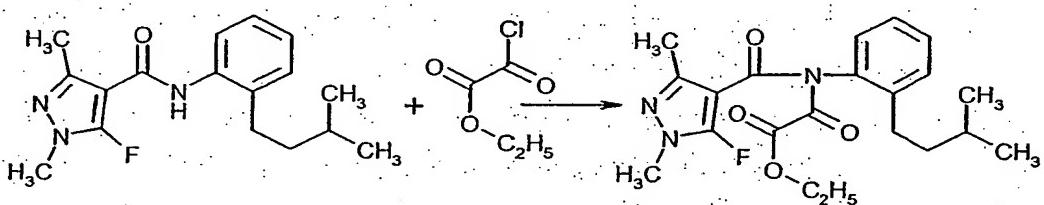
in welcher $\text{R}^{1-\text{A}}$ und X^2 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt. [Die Reaktionsbedingungen des Verfahrens (b) gelten entsprechend.]

10

Verfahren (b)

Verwendet man 5-Fluor-1,3-dimethyl-N-[2-(3-methylbutyl)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid und Ethyl-chlor(oxo)acetat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



15

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Isopentylcarboxanilide sind durch die Formel (I-a) allgemein definiert. In dieser Formel (I-a) haben R^2 , R^3 und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

20

Die Isopentylcarboxanilide der Formel (I-a) sind ebenfalls erfindungsgemäße Verbindungen und ebenfalls Gegenstand dieser Anmeldung. Sie können nach einem der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (c), (d) oder (e) erhalten werden (mit $\text{R}^1 =$ Wasserstoff).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Halogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert.

30

$\text{R}^{1-\text{A}}$ steht bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenal-

5 kylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₈-Halo-
gencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-
C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-
(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils
10 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
(C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-
C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkoxy)carbonyl,
(Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils
15 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ oder
-CH₂NR⁷R⁸.

10 R^{1-A} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl,
Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec-
oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-,
sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl,
15 Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl,
Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Tri-
fluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO,
-CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO-CH₃,
-(CH₂)₂-CO-CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH(CH₃)₂, -CH₂-CO₂CH₃, -CH₂-CO₂CH₂CH₃,
20 -CH₂-CO₂CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH(CH₃)₂,
-CH₂-CO-CF₃, -CH₂-CO-CCl₃, -CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂-CO-CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CF₃,
-(CH₂)₂-CO-CH₂CCl₃, -CH₂-CO₂CH₂CF₃, -CH₂-CO₂CF₂CF₃, -CH₂-CO₂CH₂CCl₃,
-CH₂-CO₂CCl₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CF₃, -(CH₂)₂-CO₂CF₂CF₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CCl₃,
-(CH₂)₂-CO₂CCl₂CCl₃;
25 Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl,
Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluorme-
thylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹.

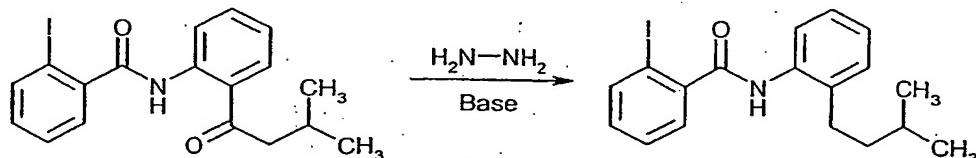
30 R^{1-A} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxymethyl, Formyl, -CH₂-CHO,
-(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -C(=O)CHO,
-C(=O)C(=O)CH₃, -C(=O)C(=O)CH₂OCH₃, -C(=O)CO₂CH₃, -C(=O)CO₂CH₂CH₃.

35 X² steht bevorzugt für Chlor oder Brom.

Halogenide der Formel (IV) sind bekannt.

Verfahren (c)

Verwendet man 2-Iod-N-[2-(3-methylbutanoyl)phenyl]benzamid als Ausgangsstoff, sowie Hydrazin und eine Base so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



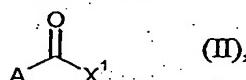
5

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Isopenton-Derivate sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) haben R¹, R², R³ und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

10

Die Isopenton-Derivate der Formel (V) sind neu. Sie werden erhalten, indem man

h) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)



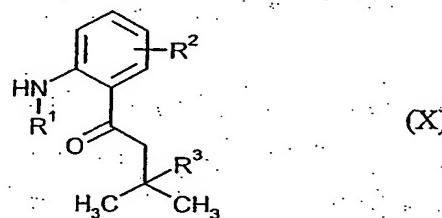
15

in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X¹ für Halogen oder Hydroxy steht,

mit Alkanonanilinen der Formel (X)



20

in welcher R¹, R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

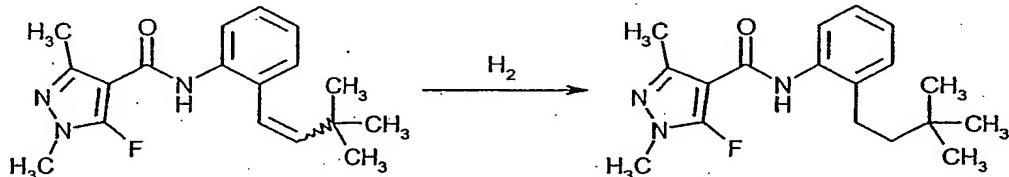
25

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate der Formel (II) wurden bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) beschrieben.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Alkanonaniline der Formel (X) wurden bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (f) beschrieben.

5 **Verfahren (d)**

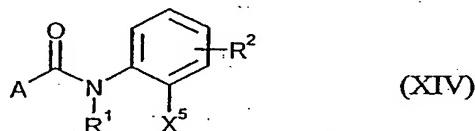
Verwendet man N-{2-[3,3-Dimethylbut-1-en-1-yl]phenyl}-5-fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carboxamid als Ausgangsstoff, sowie Wasserstoff so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



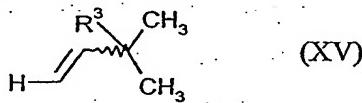
- 10 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Isopen-
ten-Derivate sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) haben R¹, R², R³
und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die
bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel
(I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben
15 wurden.

Die Isopenten-Derivate der Formel (VI) sind neu. Sie werden erhalten, indem man

j) Carboxamide der Formel (XIV)



- 20 in welcher
R¹, R² und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und
X⁵ für Chlor, Brom, Iod oder -OSO₂CF₃ steht,
mit Alkenen der Formel (XV)



- 25 in welcher R³ die oben angegebenen Bedeutungen hat,
in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenen-
falls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) als Ausgangsstoffe benötigten Carboxamide sind durch die Formel (XIV) allgemein definiert. In dieser Formel (XIV) haben R¹, R² und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. X⁵ steht bevorzugt für Brom oder -OSO₂CF₃.

10 Die Carboxamide der Formel (XIV) sind bekannt oder können nach bekannten Methoden erhalten werden (vgl. WO 02/08195 und WO 02/08197).

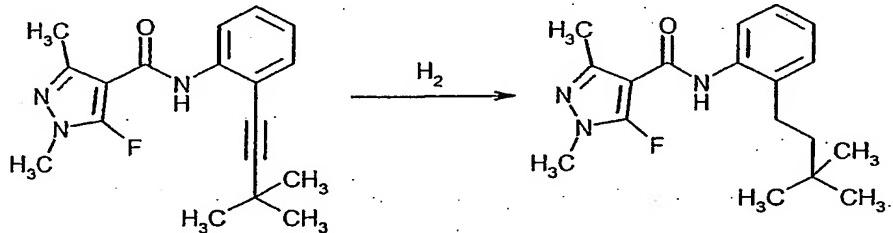
10

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Alkene sind durch die Formel (XV) allgemein definiert. In dieser Formel (XV) hat R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden.

15 Die Alkene der Formel (XV) sind bekannt.

Verfahren (e)

20 Verwendet man N-[2-(3,3-Dimethylbut-1-in-1-yl)phenyl]-5-fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carboxamid als Ausgangsstoff, sowie Wasserstoff so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

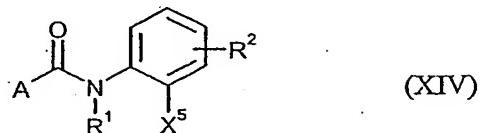


25 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) als Ausgangsstoffe benötigten Isopentin-Derivate sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VII) haben R¹, R², R³ und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

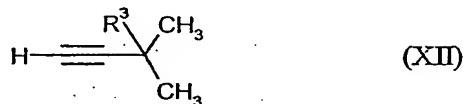
30

Die Isopentin-Derivate der Formel (VII), in welcher A nicht für A1 steht, sind neu. Die Isopentin-Derivate der Formel (VII) werden erhalten, indem man

k) Carboxamide der Formel (XIV)



in welcher
R¹, R² und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und
5 X⁵ für Chlor, Brom, Iod oder -OSO₂CF₃ steht,
mit Alkinen der Formel (XII)



in welcher R³ die oben angegebenen Bedeutungen hat,
in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenen-
10 falls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) als Ausgangsstoffe benötigten Carboxamide der Formel (XIV) sind bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (j) beschrieben worden.

15 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Alkine der Formel (XII) sind bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (g) beschrieben worden.

20 Reaktionsbedingungen

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylool oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

30 Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen

infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat,

5 Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethylbenzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

10 Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Kondensationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Amidierungsreaktionen verwendbaren Kondensationsmittel infrage. Beispielhaft genannt seien Säurehalogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisen-15 säuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; Carbodiimide, wie N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tritypyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat.

20 Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien 4-Dimethylaminopyridin, 1-Hydroxy-benzotriazol oder Dimethylformamid.

25 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C.

30 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im allgemeinen 0,2 bis 5 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Anilin-Derivat der Formel (III) ein.

35 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (V) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im allgemeinen 0,2 bis 5 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Alkanonanilin der Formel (X) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

10

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) wird in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natrium-acetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kalium-hydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Caesiumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 110°C.

25

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Isopentylcarboxanilids der Formel (I-a) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (IV) ein.

30

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

ethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril; Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan;

5 Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmono-ethylether, Triethylenglykol, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Das erfindungsgemäße Verfahren (c) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (f) wird in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydroxide, wie beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid in Frage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (f) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 100°C bis 300°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 150°C bis 250°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Isopenton-Derivatives der Formel (V) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 3 Mol an Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) ein.

Zur Durchführung des zweiten Schrittes von Verfahren (f) zur Herstellung der Verbindungen der Anilin-Derivate der Formel (III) setzt man pro Mol des Alkanonanilines der Formel (X) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 3 Mol an Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (g) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische oder alicyclische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder iso-Propanol, n-, iso-, sec- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

35 Die erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie der zweite Schritt von Verfahren (g) werden in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Als solche kommen alle Katalysatoren in Frage, die für

Hydrierungen üblicherweise verwendet werden. Beispielhaft seien genannt: Raney-Nickel, Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie beispielsweise Aktivkohle.

Die Hydrierung in den erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie im zweiten Schritt von Verfahren (g) kann statt in Gegenwart von Wasserstoff in Kombination mit einem Katalysator auch in Anwesenheit von Triethylsilan durchgeführt werden.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (g) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 100°C.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie der zweite Schritt von Verfahren (g) werden unter einem Wasserstoffdruck zwischen 0,5 und 200 bar, bevorzugt zwischen 2 und 50 bar, besonders bevorzugt zwischen 3 und 10 bar durchgeführt.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische oder alicyclische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (f) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 200°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 150°C.

Zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (f) zur Herstellung der Verbindungen der Alkanonaniline der Formel (X) setzt man pro Mol des Cyanoanilines der Formel (VIII) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 3 Mol an Grignard-Reagenz der Formel (IX) ein.

30

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (g) und der erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether,

Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan.

Der erste Schritt von Verfahren (g) und die erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogen-carbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kalium-acetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Der erste Schritt von Verfahren (g) und die erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) werden in Gegenwart eines oder mehrerer Katalysatoren durchgeführt.

Dazu eignen sich besonders Palladiumsalze oder -komplexe. Hierzu kommen vorzugsweise Palladiumchlorid, Palladiumacetat, Tetrakis-(triphenylphosphin)-Palladium oder Bis-(triphenylphosphin)-Palladiumdichlorid infrage. Es kann auch ein Palladiumkomplex in der Reaktionsmischung erzeugt werden, wenn man ein Palladiumsalz und ein Komplexligand getrennt zur Reaktion zugibt.

Als Liganden kommen vorzugsweise Organophosphorverbindungen infrage. Beispielhaft seien genannt: Triphenylphosphin, tri-o-Tolylphosphin, 2,2'-Bis(diphenylphosphino)-1,1'-binaphthyl, Di-cyclohexylphosphinebiphenyl, 1,4-Bis(diphenylphosphino)butan, Bisdiphenylphosphinoferrocen, Di(tert.-butylphosphino)biphenyl, Di(cyclohexylphosphino)biphenyl, 2-Dicyclohexylphosphino-2'-N,N-dimethylaminobiphenyl, Tricyclohexylphosphin, Tri-tert.-butylphosphin. Es kann aber auch auf Liganden verzichtet werden.

Der erste Schritt von Verfahren (g) und die erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) werden ferner gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Metallsalzes, wie Kupfersalzen, beispielsweise Kupfer(I)-iodid durchgeführt.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (g) und der erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) in einem größeren Bereich variiert werden. Im

Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 50°C bis 150°C.

5 Zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (g) zur Herstellung der Anilin-Derivate der Formel (III) setzt man pro Mol des Anilinhalogenides der Formel (XI) im allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 3 mol an Alkin der Formel (XII) ein.

10 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) zur Herstellung der Isopenten-Derivate der Formel (VI) setzt man pro Mol des Carboxamids der Formel (XIV) im allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 3 mol an Alken der Formel (XV) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) zur Herstellung der Isopentin-Derivate der Formel (VII) setzt man pro Mol des Carboxamids der Formel (XIV) im allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 3 mol an Alkin der Formel (XII) ein.

15 Wenn nicht anders angegeben, werden alle erfindungsgemäßen Verfahren im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder verminderter Druck – im Allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar – zu arbeiten.

20 Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, 25 Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

30 Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

35 Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

- Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder
Pseudoperonospora cubensis;
- Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;
- Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;
- 5 Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;
- Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
- Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;
- Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
- Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
- 10 Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
- 15 Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
- Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
- Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
- Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;
- Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;
- 20 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
- Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
- Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
- Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
- Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;
- 25 Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;
- Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;
- Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercosporella herpotrichoides*,
- Rhizoctonia-Arten, wie beispielsweise *Rhizoctonia solani*.
- 30 Die erfundungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.
- Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen

weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

10 Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

15 Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Puccinia-Arten und von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Venturia- oder Alternaria-Arten, einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

20 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbicide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

25 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, bei-

spielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen
5 Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien
10 gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können
15 technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden
20 Erfahrung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken
25 können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

30 Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:
Alternaria, wie Alternaria tenuis,
Aspergillus, wie Aspergillus niger,
Chaetomium, wie Chaetomium globosum;
Coniophora, wie Coniophora puetana,
35 Lentinus, wie Lentinus tigrinus,
Penicillium, wie Penicillium glaucum,

- Polyporus, wie Polyporus versicolor,
- Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,
- Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,
- Trichoderma, wie Trichoderma viride,
- 5 Escherichia, wie Escherichia coli,
- Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,
- Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen
10 Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen,
Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren
Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe
15 mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder
festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgier-
mitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von
Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet
20 werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol
oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlor-
benzole, Chlorethylen oder Methylenechlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder
Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Keto-
ne, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel,
25 wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streck-
mitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und
unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie
Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. natürliche Ge-
steinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diato-
meenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate.
30 Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Ge-
steine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen
und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnusschalen,
Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage: z.B.
nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fett-
35 alkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweiß-
hydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

5

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

- 10 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden 15 verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

20 **Fungizide:**

2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Brömuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin; Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolinate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofuanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenoconazole; Disflumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyridithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconiazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furamétpyr; Furcarbanil; Furmecyclox; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate;

Iminoctadine; tris(albesil); Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclbutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenoxy; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxyfen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolyfluanid; Triadimeson; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Umiconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion; 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid; 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamide; 3,4,5-Trichlor-2,6-pyridindicarbonitrile; Actinovate; cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat; Monokaliumcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid; N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Natriumtetrathiocarbonat; sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfernaphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancopper; Oxine-copper.

25 **Bakterizide:**

Bronopol; Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

30 **Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflumet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin, Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis strain EG-2348, Bacillus thuringiensis strain GC-91, Bacillus thuringiensis strain NCTC-11821, Baculoviren, Beauveria

bassiana, Beauveria tenella, Benclothiaz, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-ethyl, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb,
5 Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben, Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyrifos (-ethyl), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin,
10 Clopythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cyclopene, Cycloprothrin, Cydia pomonella, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer), Cyromazine, DDT, Deltamethrin, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Dislubenzuron, Dimefluthrin, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dibuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, DOWCO-439, Eflusilanate, Emamectin, Emamectin-benzoate, Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, Entomophthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimsos, Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxy carb, Fenpropothrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate,
15 Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocythrinate, Flucycluron, Flucythrinate, Flufennerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrazofos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb, Gamma-Cyhalothrin, Gamma-HCH, Gossypure, Grandlure, Granuloseviren, Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene, IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin, Japonilure, Kadethrin, Kernpolyederviren, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron, Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl,
20 Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metofluthrin, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800, Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-methyl, Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phentoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phospho-

- carb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Potassium oleate, Prallethrin, Profenofos, Profluthrin, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Resmethrin, RH-5 5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121, Tau-Fluvalinate, Tebufenozone, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen 10 oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralo-cythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Trichoderma atroviride, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xylylcarb, ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901, die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbamat (Tsumacide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-aza-15 bicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Iso-mere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO 96/37494, WO 98/25923), sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.
- 20 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safener bzw. Semiochemicals ist möglich.
- Darüber hinaus weisen die erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.
- Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren aus-

zubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach
5 Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von
Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha,
vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an
Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen
0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an
10 Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden.
In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle
biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und
15 Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden
transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in
Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und
deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde
oben erläutert.

20 Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in
Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit
neuen Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder
durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und
25 Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden,
Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch über-
additive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen
30 und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der
erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz
gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen
Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife,
höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere
35 Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu
erwartenden Effekte hinausgehen.

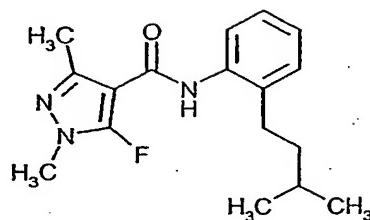
Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im Folgenden „Bt Pflanzen“). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, z.B. Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen“ seien Maissorten, Baumwollsorarten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorarten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt.

Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

- 5 Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

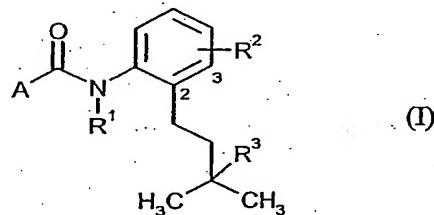
10

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

HerstellungsbeispieleBeispiel 1

- 5 Zu einer Lösung bestehend aus 388.5 mg (2.2 mmol) 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonylchlorid und 0.45 ml (3.2 mmol) Triethylamin in 20 ml Tetrahydrofuran werden 326.5 mg (2.0 mmol) [2-(3-Methylbutyl)phenyl]amin (III-1) gegeben. Die Reaktionslösung wird 90 min. bei 60°C gerührt, über Kieselgel filtriert und aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Gradient Cyclohexan/Essigsäureethylester) liefert 592 mg (98 % der Theorie) an 5-Fluor-1,3-dimethyl-N-[2-(3-methylbutyl)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid mit dem logP (pH 2.3) = 3.12.

Analog Beispiel 1 sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten.

15 Tabelle 1

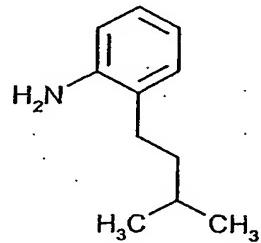
Bsp.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
2	H	H	CH ₃		3.42
3	H	H	CH ₃		4.14
4	H	H	H		3.90
5	H	H	CH ₃		4.13

Bsp.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
6	H	H	H		3.87
7	H	H	CH ₃		4.15
8	H	H	H		3.78
9	H	H	H		3.76
10	H	H	H		3.68
11	H	H	CH ₃		3.28
12	H	H	CH ₃		3.91
13	H	4-Cl	C ₂ H ₅		4.96
14	H	4-Cl	C ₂ H ₅		5.02
15	H	4-Cl	C ₂ H ₅		4.29
16	H	H	CH ₃		4.54

Bsp.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
17	H	H	C ₂ H ₅		3.68
18	H	H	C ₂ H ₅		3.59
19	H	4-Cl	C ₂ H ₅		4.10
20	H	4-F	CH ₃		3.34
21	H	4-F	CH ₃		4.14
22	H	4-F	CH ₃		3.34
23	H	4-F	CH ₃		3.57
24	H	4-F	CH ₃		4.05

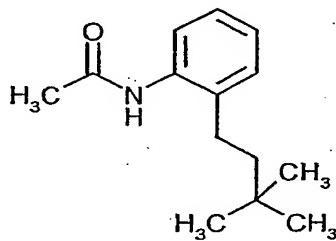
Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (III)

5 Beispiel (III-1)



Eine Lösung bestehend aus 8.0 g (0.045 mol) 1-(2-Amino-phenyl)-3-methyl-butan-1-on (X-1), 6.8 g (0.135 mol) Hydrazin-hydrat und 7.6 g (0.135 mol) Kaliumhydroxid in 90 ml Triethylenglycol wird für 6 h auf 210°C erhitzt. Zur Aufarbeitung wird bei Raumtemperatur Wasser und Essigsäureethylester zugegeben. Die organische Phase wird erneut mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und unter verminderter Druck aufkonzentriert. Reinigung durch Säulenchromatographie (Cyclohexan/Essigsäureethylester 3:1) liefert 5.3 g (71.5 % der Theorie) an [2-(3-Methylbutyl)-phenyl]amin.

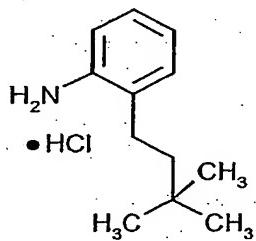
Beispiel (III-2)



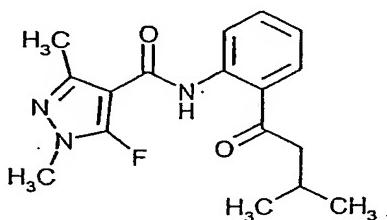
10

3.23 g (15 mmol) N-[2-(3,3-Dimethyl-but-1-inyl)-phenyl]-acetamid (XIII-1) wurden in 40 ml Methanol vorgelegt. Man gab 0.5 g Palladium-Kohle (5 %) zu und hydriert anschließend im Autoklaven 20 h bei 4 bar Wasserstoffdruck. Nach Abtrennung des Katalysators und Entfernung des Lösungsmittels erhielt man 3.1 g (94 % der Theorie) an N-[2-(3,3-Dimethyl-butyl)-phenyl]-acetamid mit dem logP (pH 2.3) = 2.69.

Beispiel (III-3)

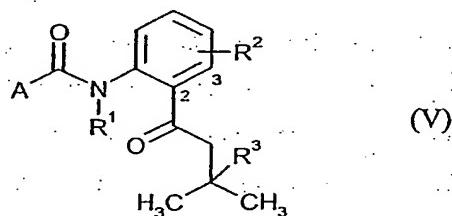


0.5 g (2.3 mmol) N-[2-(3,3-Dimethyl-butyl)-phenyl]-acetamid (III-2) wurden in 20 ml 2N Salzsäure 20 5 h bei 100°C gerührt. Nach dem Abkühlen wurde 3 mal mit je 20 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wurde abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und eingeengt. Man erhielt 390 mg (79 % der Theorie) an 2-(3,3-Dimethyl-butyl)-phenylamin-Hydrochlorid mit dem logP (pH 2.3) = 2.20.

Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (V)Beispiel (V-1)

- 5 Bei Raumtemperatur werden 355.0 mg (2.0 mmol) 1-(2-Amino-phenyl)-3-methyl-butan-1-on zu einer Lösung bestehend aus 388.5 mg (2.2 mmol) 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonyl-chlorid und 0.45 ml (3.2 mmol) Triethylamin in 20 ml Tetrahydrofuran gegeben. Die Reaktionsmischung wird für 1.5 h bei 60°C gerührt, über Kieselgel filtriert und aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Cyclohexan/Essigester : 3/1) liefert 577.7 mg (1.8 mmol, 88 % der Theorie) an 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäure-[2-(3-methyl-butyryl)-phenyl]-amid mit dem logP (pH = 2.3) = 3.42.
- 10
- 15

Analog Beispiel (V-1) sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden die in der nachstehenden Tabelle 2 genannten Verbindungen der Formel (V) erhalten.

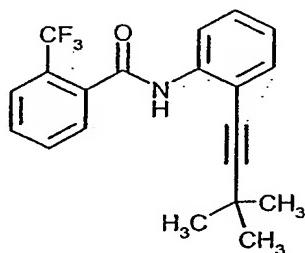
Tabelle 2

Bsp.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
V-2	H	H	H		4.30
V-3	H	H	H		4.33
V-4	H	H	H		4.53

Bsp.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
V-5	H	H	H		4.35
V-6	H	H	H		4.30
V-7	H	H	H		4.44

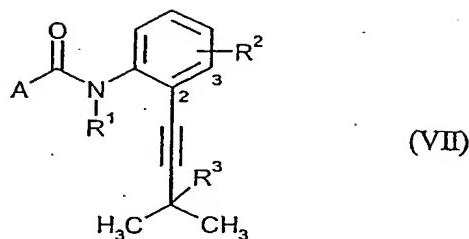
Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (VII)

5 Beispiel (VII-1)



190 mg (1.0 mmol) 2-Trifluormethylbenzoësäure, 178 mg (0.83 mmol) 2-(3,3-Dimethyl-but-1-inyl)-phenylamin, 215 mg (1.67 mmol) N,N-Diisopropylethylamin und 583 mg (1.25 mmol) PyBrOP wurden in 8 ml Acetonitril 4 Tage bei Raumtemperatur gerührt. Das Gemisch wurde mit 10 ml Essigsäureethylester/Wasser 1:1 versetzt, die organische Phase abgetrennt und mit 10 ml gesättigter Ammoniumchlorid-Lösung und anschließend mit 10 ml Wasser gewaschen. Abtrennen, Einengen und Trocknen der organischen Phase lieferte 950 mg Rohprodukt. Nach säulenchromatographischer Reinigung über Kieselgel 60 (Petrolether/Essigsäureethylester 10:1 → Essigsäureethylester) wurden 110 mg N-[2-(3,3-Dimethyl-but-1-inyl)-phenyl]-2-trifluoromethyl-benzamid erhalten [logP (pH 2.3) = 4.55].

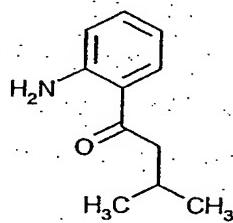
Analog Beispiel (VII-1) sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden die in der nachstehenden Tabelle 3 genannten Verbindungen der Formel (VII) erhalten.

Tabelle 3

Bsp.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
VII-2	H	H	CH ₃		4.73
VII-3	H	H	CH ₃		3.75
VII-4	H	H	CH ₃		4.52
VII-5	H	H	CH ₃		4.17

5 Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (X)

Beispiel (X-1)

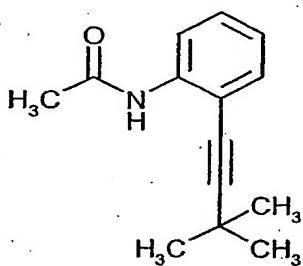


Eine Lösung aus 29.5 g (0.25 mol) Antranilsäurenitril in 150 ml Tetrahydrofuran wird bei Rückfluss zu einer Suspension bestehend aus 18.2 g (0.75 mol) Magnesium, 375 ml einer 2 M Lösung von Isobutylmagnesiumbromid in Tetrahydrofuran und 15 ml Diethylether getropft. Nach 5 h Erhitzen unter Rückfluss wird die Reaktionsmischung bei 0°C mit 100 ml Wasser versetzt, und der pH-Wert mit Salzsäure auf 6 eingestellt. Die organische Phase wird mit Wasser gewaschen und über Magnesiumsulfat getrocknet. Aufkonzentration im Vakuum und Reinigung an Kieselgel (Eluent:

Petrolether/Aceton 95:5) liefert 11.0 g (25 % der Theorie) an 1-(2-Amino-phenyl)-3-methyl-butan-1-on mit dem logP (pH 2.3) = 2.89.

5 Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (XIII)

Beispiel (XIII-1)



25.7 g (120 mmol) ortho-Bromacetanilid, 5.05 g (7.2 mmol) Bis(triphenylphosphin)palladium(II)chlorid und 1.37 g (7.2 mmol) Kupfer(I)iodid wurden in 450 ml Triethylamin unter Argon vorgelegt. Anschließend wurde bei Raumtemperatur innerhalb von 10 min. 17.8 g (180 mmol) 3,3-Dimethyl-1-butin zugetropft und 5 h bei 50°C gerührt. Die Reaktionsmischung wurde auf 2 l Wasser gegossen, 3 mal mit je 250 ml Diethylether extrahiert, über Natriumsulfat getrocknet und eingeengt. Nach säulenchromatographischer Reinigung über Kieselgel 60 mit Methylenechlorid erhält man 25.9 g
10 an N-[2-(3,3-Dimethyl-but-1-inyl)-phenyl]-acetamid mit dem logP (pH 2.3) = 3.03.
15

Die Bestimmung der in den voranstehenden Tabellen und Herstellungsbeispielen angegebenen logP-Werte erfolgt gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

- 20 Die Bestimmung erfolgt im sauren Bereich bei pH 2.3 mit 0,1 % wässriger Phosphorsäure und Acetonitril als Eluenten; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.
Die Eichung erfolgt mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).
25 Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Anwendungsbeispiele:Beispiel A5 **Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv**

Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton

 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

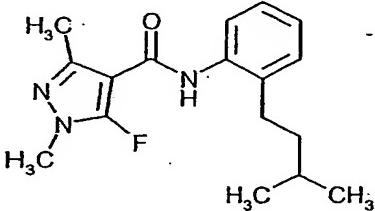
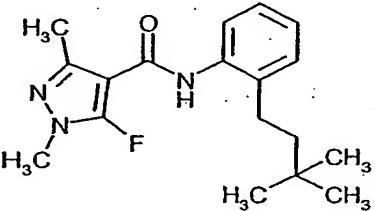
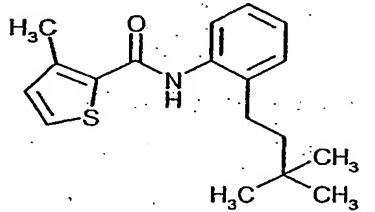
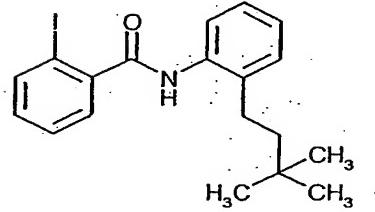
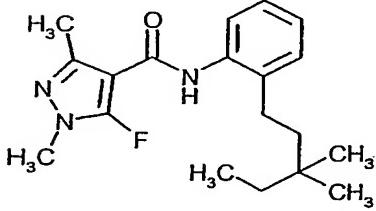
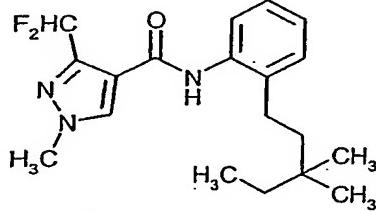
15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Apfelmehltauerregers *Podosphaera leucotricha* inkuliert. Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

20

10 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

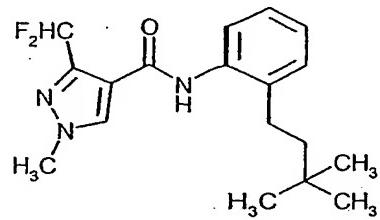
Tabelle A

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

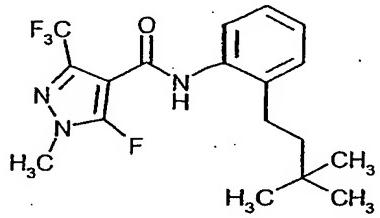
Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	100	100
	100	100
	100	99
	100	97
	100	99
	100	100

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
------------------------------	--------------------------------------	----------------------



100 100



100 100

Beispiel B**Venturia - Test (Apfel) / protektiv**

5 Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers Venturia inaequalis inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

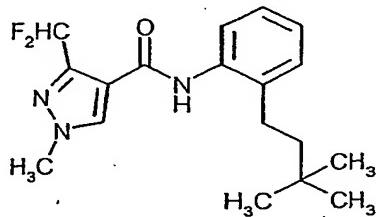
Tabelle B

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

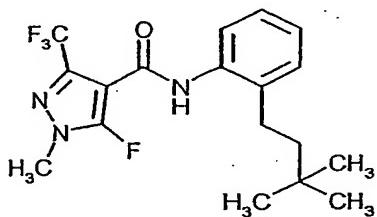
Wirkstoff Erfundungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	100	96
	100	100
	100	99
	100	97
	100	100
	100	100

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

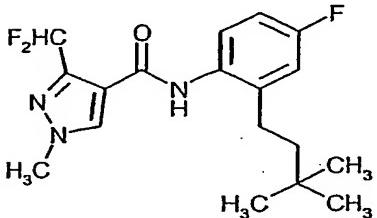
Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
------------------------------	--------------------------------------	----------------------



100 100



100 100



100 100

Beispiel C**Botrytis - Test (Bohne) / protektiv**

5 Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

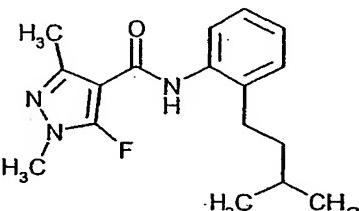
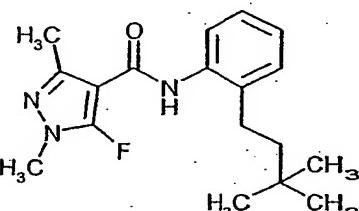
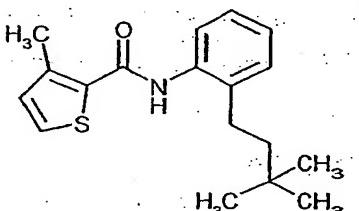
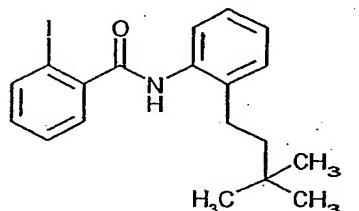
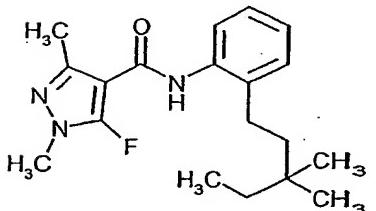
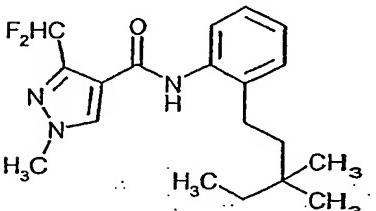
10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis cinerea bewachsene Agarstückchen aufgelegt. Die inkulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

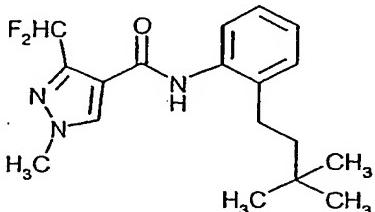
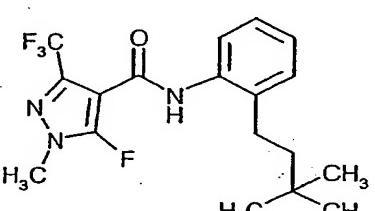
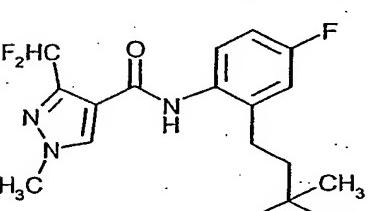
20 2 Tage nach der Inkulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle C

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	84
	500	100
	500	100
	500	87
	500	100
	500	100

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	100
	500	100
	500	100

Beispiel D**Puccinia-Test (Weizen) / kurativ**

- 5 Lösungsmittel: 50 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid
Emulgator: 1 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

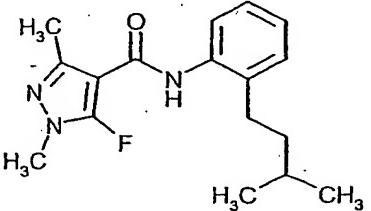
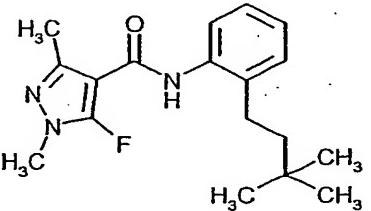
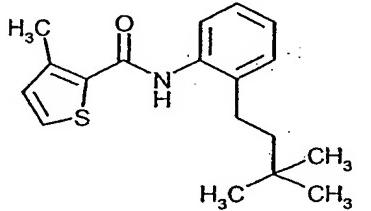
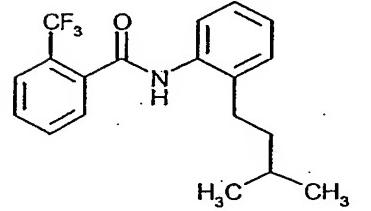
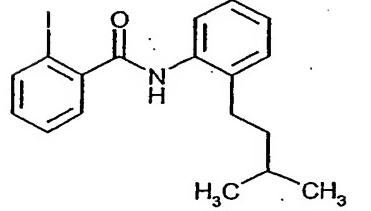
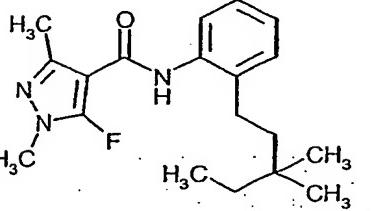
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser
10 auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf kurative Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit einer Konidiensuspension von Puccinia recondita besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine. Anschließend werden die Pflanzen mit der Wirkstoff-
15 zubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht.

- Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von Rostpusteln zu begünstigen.
20 8 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

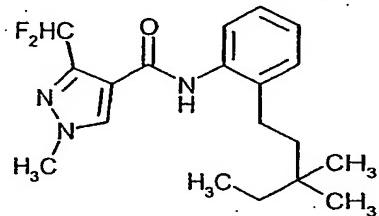
Tabelle D

Puccinia-Test (Weizen) / kurativ

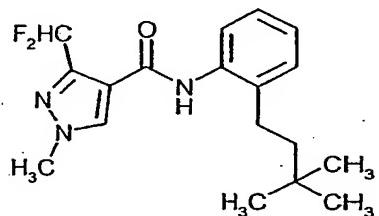
Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Puccinia-Test (Weizen) / kurativ

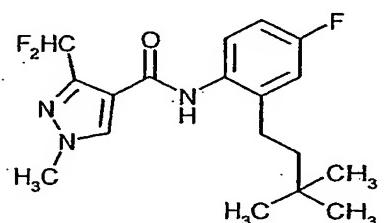
Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
------------------------------	--------------------------------------	----------------------



500 100



500 100



500 100

Beispiel E**Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv**

5 Lösungsmittel: 49 Gewichtsteile N, N-Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser
10 auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Gurkenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Sphaerotheca fuliginea* inkokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in
15 einem Gewächshaus bei 70 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 23°C aufgestellt.

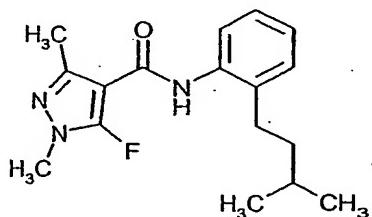
7 Tage nach der Inkokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

20

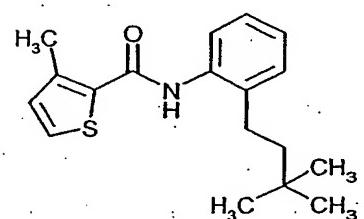
Tabelle E

Sphaerotheça-Test (Gurke) / protektiv

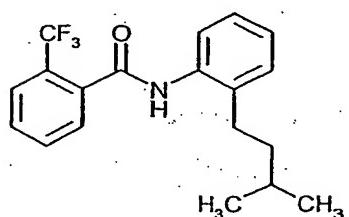
Wirkstoff Erfundungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
------------------------------	--------------------------------------	----------------------



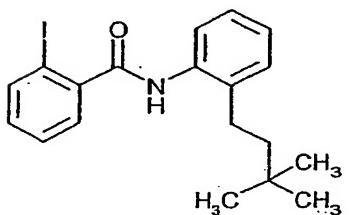
750 100



750 100



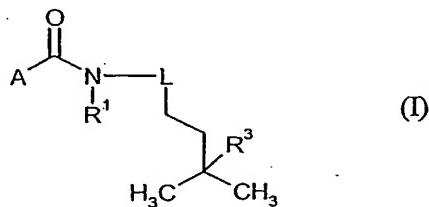
750 100



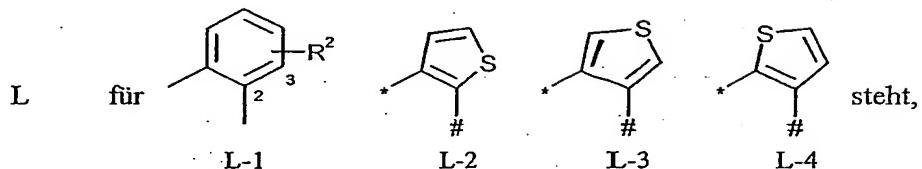
750 100

Patentansprüche

1. Isopentylcarboxanilide der Formel (I)



5 in welcher



wobei die mit * markierte Bindung mit dem Amid verbunden ist, während die mit # markierte Bindung mit der Alkylseitenkette verknüpft ist,

10 R¹ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

15 (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht,

20 R² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl steht,

R³ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl steht,

25 R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl steht,

alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

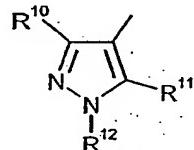
R⁵ und R⁶ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹ enthalten kann,

R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R⁷ und R⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹ enthalten kann,

R⁹ für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht,

A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

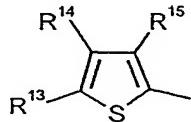
R¹⁰ für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Cyano, Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl steht,

R¹¹ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, steht und

R¹² für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder für Phenyl steht, mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Iod steht, wenn R¹¹ für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R³ und R¹¹ für Wasserstoff und R¹² für Methyl stehen,

oder

A für den Rest der Formel (A2)



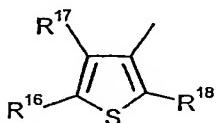
(A2) steht, in welcher

R¹³ und R¹⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder
C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R¹⁵ für Halogen, Cyano oder C₁-C₄-Alkyl, oder C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-
C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)



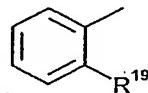
(A3) steht, in welcher

R¹⁶ und R¹⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder
C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R¹⁸ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halo-
genatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)

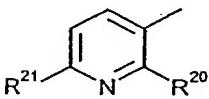


(A4) steht, in welcher

R¹⁹ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl,
C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5
Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



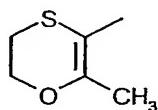
(A5) steht, in welcher

R²⁰ für Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-
thio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogen-
alkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R²¹ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-
Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5
Halogenatomen, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl steht,

oder

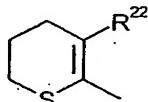
A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)



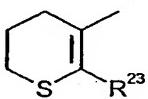
(A7) steht, in welcher

5

R²² für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)



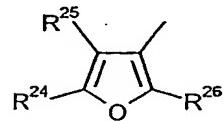
(A8) steht, in welcher

10

R²³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A9)



(A9) steht, in welcher

R²⁴ und R²⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

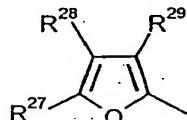
15 R²⁶ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 to 5 Halogen-
atomen steht,

mit der Maßgabe, dass R²⁴ und R²⁶ nicht gleichzeitig für Methyl stehen, wenn R²⁵
für Wasserstoff steht,

20

oder

A für den Rest der Formel (A10)



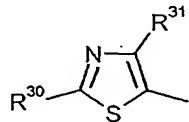
(A10) steht, in welcher

R²⁷ und R²⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

25 R²⁹ für Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



(A11) steht, in welcher

R³⁰ für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

5

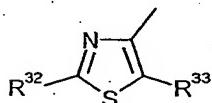
R³¹ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

10

mit der Maßgabe, dass R³¹ nicht für Trifluormethyl, Difluormethyl oder Methyl steht, wenn R³ für Wasserstoff und R³⁰ für Methyl stehen,

oder

A für den Rest der Formel (A12)



(A12) steht, in welcher

R³² für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

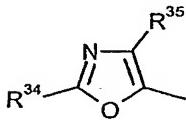
15

R³³ für Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

20

A für den Rest der Formel (A13)



(A13) steht, in welcher

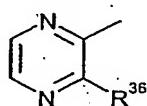
R³⁴ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht und

R³⁵ für Halogen oder C₁-C₄-Alkyl steht,

oder

25

A für den Rest der Formel (A14)

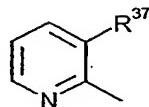


(A14) steht, in welcher

R³⁶ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A15)



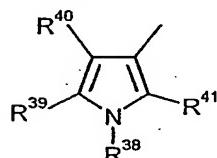
(A15) steht, in welcher

R³⁷ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

5

oder

A für den Rest der Formel (A16)



(A16) steht, in welcher

R³⁸ für Wasserstoff, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminosulfonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

10

R³⁹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

15

R⁴⁰ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

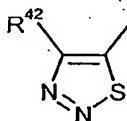
R⁴¹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R⁴⁰ nicht für Trifluormethyl steht,

20

oder

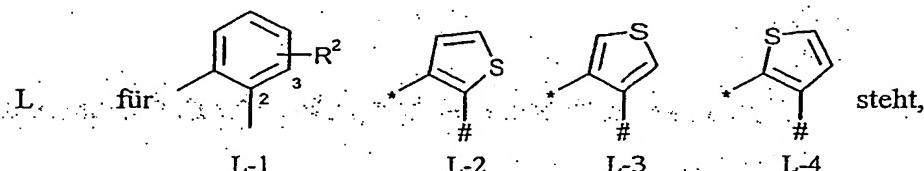
A für den Rest der Formel (A17)



(A17) steht, in welcher

R⁴² für C₁-C₄-Alkyl steht.

25 2. Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher



wobei die mit * markierte Bindung mit dem Amid verbunden ist, während die mit # markierte Bindung mit der Alkylseitenkette verknüpft ist,

R¹ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₈-Halogenycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

10 (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogenycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht,

R² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl steht,

R³ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl mit 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht;

20 R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogenycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

25 R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogenycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

30 R⁵ und R⁶ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹ enthalten kann,

R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogenycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen;

35 R⁷ und R⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen

oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹ enthalten kann,

R⁹ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht,

5

A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

R¹⁰ für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Cyclopropyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Aminocarbonyl, Aminocarbonylmethyl oder Aminocarbonylethyl steht,

R¹¹ für Wasserstoff, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, steht und

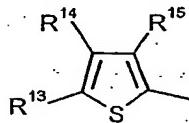
R¹² für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder Phenyl steht,

mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Iod steht, wenn R¹¹ für Wasserstoff steht, und

20 mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R³ und R¹¹ für Wasserstoff und R¹² für Methyl stehen,

oder

A für den Rest der Formel (A2)



(A2) steht, in welcher

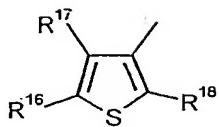
25 R¹³ und R¹⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen stehen und

R¹⁵ für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

30

oder

A für den Rest der Formel (A3)



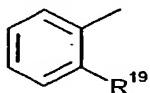
(A3) steht, in welcher

R¹⁶ und R¹⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen stehen und

5 R¹⁸ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)

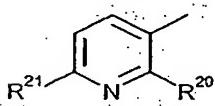


(A4) steht, in welcher

10 R¹⁹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



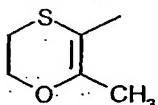
(A5) steht, in welcher

15 R²⁰ für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht und

20 R²¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, C₁-C₂-Alkylsulfinyl oder C₁-C₂-Alkylsulfonyl steht,

oder

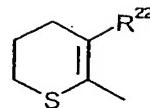
A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

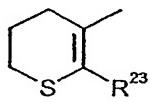


(A7) steht, in welcher

R²² für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

5 A für den Rest der Formel (A8)

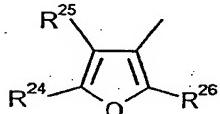


(A8) steht, in welcher

R²³ für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

10 A für den Rest der Formel (A9)



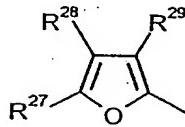
(A9) steht, in welcher

R²⁴ und R²⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht und

15 R²⁶ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, mit der Maßgabe, dass R²⁴ und R²⁶ nicht gleichzeitig für Methyl stehen, wenn R²⁵ für Wasserstoff steht,

oder

20 A für den Rest der Formel (A10)



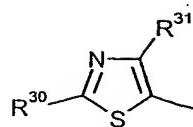
(A10) steht, in welcher

R²⁷ und R²⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Nitro, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen stehen und

25 R²⁹ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



(A11) steht, in welcher

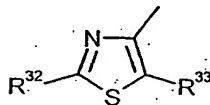
R³⁰ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht und

5 R³¹ für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Cyclopropyl, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R³¹ nicht für Trifluormethyl, Difluormethyl oder Methyl steht, wenn R³ für Wasserstoff und R³⁰ für Methyl stehen,

10 oder

A für den Rest der Formel (A12)



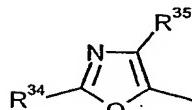
(A12) steht, in welcher

R³² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht und

15 R³³ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A13)



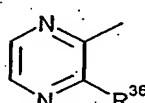
(A13) steht, in welcher

20 R³⁴ für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht und

R³⁵ für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A14)

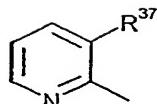


(A14) steht, in welcher

25 R³⁶ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A15)

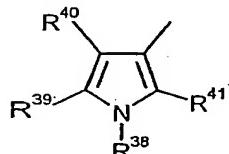


(A15) steht, in welcher

R^{37} für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder 5
Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A16)



(A16) steht, in welcher

R^{38} für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, 10
Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₂-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, methylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

R^{39} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

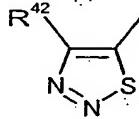
R^{40} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R^{41} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R^{40} nicht für Trifluormethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A17)

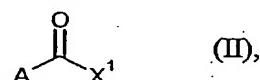


(A17) steht, in welcher

R^{42} für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl steht.

3. Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, in welcher L für L-1 steht.
- 25 4. Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, in welcher L für L-2 steht.
5. Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, in welcher R¹ für Wasserstoff, Formyl oder -C(=O)C(=O)R⁴ steht, wobei R⁴ die in Anspruch 1 oder 2
angegebenen Bedeutungen hat.
- 30

6. Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, in welcher A für A1 steht.
7. Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, in welcher R³ für Wasserstoff steht.
- 5
8. Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, in welcher R³ für Halogen, C₁-C₈-Alkyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl steht.
9. Verfahren zum Herstellen der Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man
- 10 a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

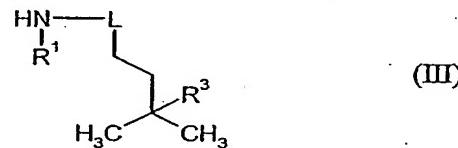


in welcher

A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat und

15 X¹ für Halogen oder Hydroxy steht,

mit einem Anilin-Derivat der Formel (III)



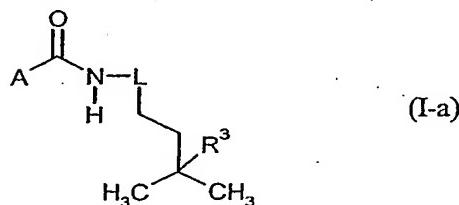
in welcher L, R¹ und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

20

oder

b) Isopentylcarboxanilide der Formel (I-a)



25 in welcher

L, A und R³ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben

mit Halogeniden der Formel (IV)

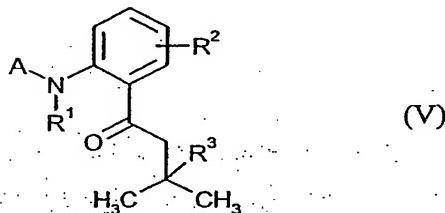


in welcher

X^2 für Chlor, Brom oder Iod steht,
 R^{1-A} für C_1-C_8 -Alkyl, C_1-C_6 -Alkylsulfinyl, C_1-C_6 -Alkylsulfonyl, C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl; C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Halogenalkylthio, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_8 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- C_1-C_3 -alkyl, (C_1-C_3 -Alkyl)-carbonyl- C_1-C_3 -alkyl, (C_1-C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl; Halogen-(C_1-C_3 -alkyl)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl, Halogen-(C_1-C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C_1-C_3 -Alkyl)carbonyl, (C_1-C_3 -Alkoxy)carbonyl, (C_1-C_4 -Alkoxy- C_1-C_4 -alkyl)-carbonyl, (C_3-C_8 -Cycloalkyl)carbonyl; (C_1-C_6 -Halogenalkyl)carbonyl, (C_1-C_6 -Halogenalkoxy)carbonyl, ($Halogen-C_1-C_4$ -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl)carbonyl, (C_3-C_8 -Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^4$, $CONR^5R^6$ oder $-CH_2NR^7R^8$ steht,
wobei R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,
in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

c) Isopenton-Derivate der Formel (V)

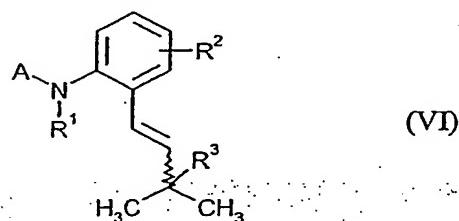


in welcher

R^1 , R^2 , R^3 und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,
mit Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in
Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

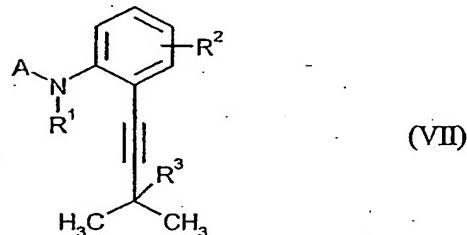
d) Isopenten-Derivate der Formel (VI)

in welcher R^1 , R^2 , R^3 und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert,

oder

- e) Isopentin-Derivate der Formel (VII)



5

in welcher R¹, R², R³ und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

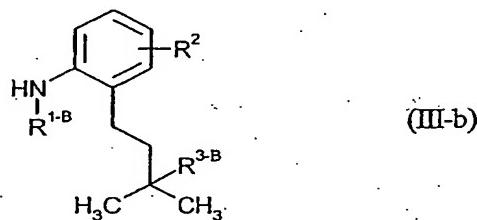
10 10. Mittel zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Isopentylcarboxanilid der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

11. Verwendung von Isopentylcarboxaniliden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen.

12. Verfahren zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum aus bringt.

20 13. Verfahren zum Herstellen von Mitteln zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

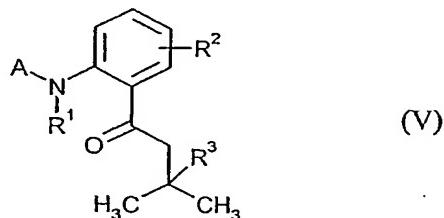
25 14. Anilin-Derivate der Formel (III-b)



in welcher

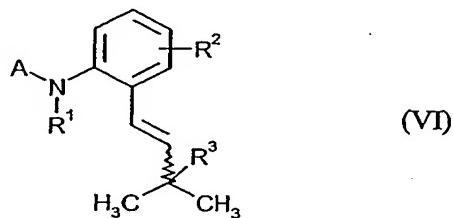
- 5 a) R^{1-B} für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)-carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- 10 (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht, und
- 15 b) R^{3-B} für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl steht,
- oder
- 20 b) R^{1-B} für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)-carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- 25 (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht, und
- 30 R^{3-B} für Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl steht,
- und R², R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ jeweils die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

15. Isopenton-Derivate der Formel (V)



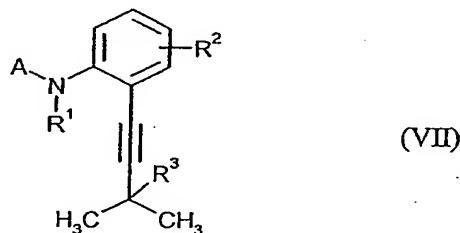
in welcher R¹, R², R³ und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

5 16. Isopenten-Derivate der Formel (VI)



in welcher R¹, R², R³ und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

17. Isopentin-Derivate der Formel (VII)



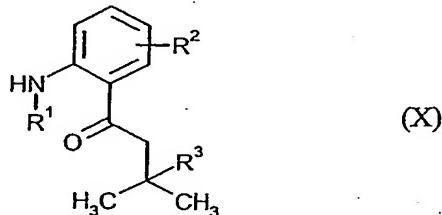
10

in welcher

R¹, R² und R³ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen mit Ausnahme von A1 hat.

15 18. Alkanonaniline der Formel (X)



in welcher R¹, R² und R³ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2004/011408

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7	C07D231/14	C07D333/38	C07C233/66	C07D277/56	C07C211/46
	C07D307/68	C07D213/82	A01N43/56	A01N43/40	A01N43/78
	A01N43/32	A01N43/08			

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D C07C A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 03/010149 A (MAULER-MACHNIK ASTRID ; DUNKEL RALF (DE); RIECK HEIKO (DE); BAYER AG () 6 February 2003 (2003-02-06) page 62; examples I-53 abstract; claims; examples	17
A		1, 10-16, 18
X, P	DATABASE CAPLUS CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 8 January 2004 (2004-01-08), XP002313917 retrieved from STN Database accession no. 1958:113426 abstract & WO 2004/002481 A (NOVO NORDISK) 8 January 2004 (2004-01-08)	18
	—/—	

 Further documents are listed in the continuation of box C. Patent family members are listed in annex.

Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 January 2005

Date of mailing of the International search report

01/03/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Stix-Malaun, E

BEST AVAILABLE COPY

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/011408

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,P	KESSLER ET AL: "Indole synthesis by controlled carbolithiation of o-aminostyrenes" J.ORG.CHEM, vol. 69, no. 23, July 2004 (2004-07), pages 7836-46, XP002313916 page 7839; examples 4a,4b; table 3	14
X	DATABASE CAPLUS CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1958, XP002313918 retrieved from STN Database accession no. 2004:20494 abstract & HARVEY ET AL: J.CHEM.SOC. ABSTRACTS, 1958, pages 2060-2062,	1,14
X	DATABASE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE FOR ORGANIC CHEMISTRY, FRANKFURT-MAIN, DE; 1976, XP002313919 Database accession no. BRN 2832215 abstract & HANNIG ET AL: PHARMAZIE, vol. 31, 1976, pages 535-536,	18
X	DATABASE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE FOR ORGANIC CHEMISTRY, FRANKFURT-MAIN, DE; 2000, XP002313920 Database accession no. BRN 8617070 abstract & TABUCHI ET AL: CME.PHARM.BULL, vol. 48, no. 1, 2000, pages 1-15,	18
A	WO 02/38542 A (WALTER HARALD ; SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)) 16 May 2002 (2002-05-16) abstract examples claims	1-18
A	EP 0 824 099 A (MITSUI TOATSU CHEMICALS) 18 February 1998 (1998-02-18) abstract examples claims	1-18

BEST AVAILABLE COPY

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

EP2004/011408

Continuation of II.1

Although claims 12 and 13 relate to a method for treatment of the human or animal body, the search was carried out on the basis of the alleged effects of the compound or composition.

Claims 15-17 were searched as amides rather than amines (structural component ACONR¹ rather than A-NR¹), which is consistent with the examples and the overall thrust of the application.

BEST AVAILABLE COPY

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

SEE SEPARATE SHEET PCT/ISA/210

2. Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/011408

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
WO 03010149	A	06-02-2003	DE BR WO EP HU US	10136065 A1 0211482 A 03010149 A1 1414803 A1 0401478 A2 2004204470 A1		13-02-2003 17-08-2004 06-02-2003 06-05-2004 29-11-2004 14-10-2004
WO 2004002481	A	08-01-2004	AU WO WO EP US US	2002349299 A1 03047626 A1 2004002481 A1 1453541 A1 2003138416 A1 2004122235 A1		17-06-2003 12-06-2003 08-01-2004 08-09-2004 24-07-2003 24-06-2004
WO 0238542	A	16-05-2002	AU BR CA CN EG WO EP HU JP ZA	2366802 A 0115200 A 2426033 A1 1484637 T 23122 A 0238542 A1 1341757 A1 0302471 A2 2004513163 T 200303012 A		21-05-2002 17-02-2004 16-05-2002 24-03-2004 28-04-2004 16-05-2002 10-09-2003 28-11-2003 30-04-2004 20-05-2004
EP 0824099	A	18-02-1998	CA CN CN DE DE EP ES JP US US	2213111 A1 1338452 A 1178791 A , B 69708004 D1 69708004 T2 0824099 A1 2164972 T3 10310577 A 5965774 A 5914344 A		15-02-1998 06-03-2002 15-04-1998 13-12-2001 18-04-2002 18-02-1998 01-03-2002 24-11-1998 12-10-1999 22-06-1999

BEST AVAILABLE COPY

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/011408

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D231/14 C07D333/38 C07C233/66 C07D277/56 C07C211/46
C07D307/68 C07D213/82 A01N43/56 A01N43/40 A01N43/78
A01N43/32 A01N43/08

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D C07C A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 03/010149 A (MAULER-MACHNIK ASTRID ; DUNKEL RALF (DE); RIECK HEIKO (DE); BAYER AG () 6. Februar 2003 (2003-02-06) Seite 62; Beispiele I-53	17
A	Zusammenfassung; Ansprüche; Beispiele	1,10-16, 18
X,P	DATABASE CAPLUS CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 8. Januar 2004 (2004-01-08), XP002313917 gefunden im STN Database accession no. 1958:113426 Zusammenfassung & WO 2004/002481 A (NOVO NORDISK) 8. Januar 2004 (2004-01-08)	18

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

- * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
 A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
 E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
 L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
 O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
 P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
 X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
 Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
 & Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
27. Januar 2005	01/03/2005

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter Stix-Malaun, E
---	---

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/011408

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Beitr. Anspruch Nr.
X,P	KESSLER ET AL: "Indole synthesis by controlled carbolithiation of o-aminostyrenes" J.ORG.CHEM, Bd. 69, Nr. 23, Juli 2004 (2004-07), Seiten 7836-46, XP002313916 Seite 7839; Beispiele 4a,4b; Tabelle 3	14
X	DATABASE CAPLUS CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1958, XP002313918 gefunden im STN Database accession no. 2004:20494 Zusammenfassung & HARVEY ET AL: J.CHEM.SOC. ABSTRACTS, 1958, Seiten 2060-2062,	1,14
X	DATABASE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE FOR ORGANIC CHEMISTRY, FRANKFURT-MAIN, DE; 1976, XP002313919 Database accession no. BRN 2832215 Zusammenfassung & HANNIG ET AL: PHARMAZIE, Bd. 31, 1976, Seiten 535-536,	18
X	DATABASE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE FOR ORGANIC CHEMISTRY, FRANKFURT-MAIN, DE; 2000, XP002313920 Database accession no. BRN 8617070 Zusammenfassung & TABUCHI ET AL: CME.PHARM.BULL, Bd. 48, Nr. 1, 2000, Seiten 1-15,	18
A	WO 02/38542 A (WALTER HARALD ; SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)) 16. Mai 2002 (2002-05-16) Zusammenfassung Beispiele Ansprüche	1-18
A	EP 0 824 099 A (MITSUI TOATSU CHEMICALS) 18. Februar 1998 (1998-02-18) Zusammenfassung Beispiele Ansprüche	1-18

BEST AVAILABLE COPY

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHTnationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/011408**Feld II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)**

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. Ansprüche Nr. weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
siehe BEIBLATT PCT/ISA/210
2. Ansprüche Nr. weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. Ansprüche Nr. weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

Feld III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

1. Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.
 Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld II.1

Obwohl die Ansprüche 12,13 sich auf ein Verfahren zur Behandlung des menschlichen/tierischen Körpers beziehen, wurde die Recherche durchgeführt und gründete sich auf die angeführten Wirkungen der Verbindung/Zusammensetzung.

Die Ansprüche 15-17 wurden als Amide anstatt Amine recherchiert (Strukturteil ACONR1 anstatt A-NR1) was im Einklang mit den Beispielen und der Gesamtaussage der Anmeldung steht.

BEST AVAILABLE COPY

INTERNATIONALES RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/011408

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 03010149	A	06-02-2003	DE	10136065 A1		13-02-2003
			BR	0211482 A		17-08-2004
			WO	03010149 A1		06-02-2003
			EP	1414803 A1		06-05-2004
			HU	0401478 A2		29-11-2004
			US	2004204470 A1		14-10-2004
WO 2004002481	A	08-01-2004	AU	2002349299 A1		17-06-2003
			WO	03047626 A1		12-06-2003
			WO	2004002481 A1		08-01-2004
			EP	1453541 A1		08-09-2004
			US	2003138416 A1		24-07-2003
			US	2004122235 A1		24-06-2004
WO 0238542	A	16-05-2002	AU	2366802 A		21-05-2002
			BR	0115200 A		17-02-2004
			CA	2426033 A1		16-05-2002
			CN	1484637 T		24-03-2004
			EG	23122 A		28-04-2004
			WO	0238542 A1		16-05-2002
			EP	1341757 A1		10-09-2003
			HU	0302471 A2		28-11-2003
			JP	2004513163 T		30-04-2004
			ZA	200303012 A		20-05-2004
EP 0824099	A	18-02-1998	CA	2213111 A1		15-02-1998
			CN	1338452 A		06-03-2002
			CN	1178791 A ,B		15-04-1998
			DE	69708004 D1		13-12-2001
			DE	69708004 T2		18-04-2002
			EP	0824099 A1		18-02-1998
			ES	2164972 T3		01-03-2002
			JP	10310577 A		24-11-1998
			US	5965774 A		12-10-1999
			US	5914344 A		22-06-1999

BEST AVAILABLE COPY